

## ⑫ 公開特許公報(A)

昭61-87695

⑬ Int. Cl.<sup>4</sup>

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 昭和61年(1986)5月6日

C 07 K 7/20

A 61 K 37/24

// C 07 K 99:54

A E E

6464-4H

7138-4C

6464-4H

審査請求 未請求 発明の数 1 (全13頁)

⑮ 発明の名称 GnRH拮抗物質

⑯ 特 願 昭60-197532

⑰ 出 願 昭60(1985)9月6日

優先権主張 ⑱ 1984年9月7日 ⑲ 米国(US) ⑳ 648637

㉑ 発 明 者 ワイリー・ウォーカ アメリカ合衆国カリフォルニア州92037, ラ・ホーラ, バ  
ー・ペール・ジュニア ルデズ 1643㉒ 発 明 者 ジャン・エドワール・ アメリカ合衆国カリフォルニア州92037, ラ・ホーラ, ブ  
フレデリック・リベール ラックゴールド・ロード 9674㉓ 出 願 人 ザ・サルク・インステ アメリカ合衆国カリフォルニア州ラ・ホーラ, ノース・ト  
チユート・フオー・バレー・バインズ・ロード 10010  
イオロジカル・スタデ  
イーズ

㉔ 代 理 人 弁理士 湯浅 恭三 外5名

## 明 細 書

## 1. [ 発明の名称 ]

GnRH 拮抗物質

## 2. [ 特許請求の範囲 ]

## (1) 次式:

$$X-R_1-(W)D-Phe-R_3-R_4-R_5-R_6(V)-R_7-Arg-Pro-R_{10}$$

[ 式中、Xは水素原子または7個以下の炭素原子を有するアシル基であり;

$R_1$ はデヒドロ-Pro, Pro, D-pGlu, D-Phe, D-Trp または  $\beta$ -D-NAL であり;

WはF, Cl,  $Cl_2$ , Br,  $NO_2$  または  $C^{\alpha}Me-Cl$  であり;

$R_3$ はD-Trp, (N<sup>10</sup>For)D-Trp または  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $OCH_3$ , F, Cl, Br または  $CH_3$  で5位または6位が置換されたD-Trp であり;

$R_4$ はSer, Orn, AAL または  $\alpha Bu$  であり;

$R_5$ はTyr, (3F)Phe, (2F)Phe, (3I)Tyr, (3CH<sub>3</sub>)Phe, (2CH<sub>3</sub>)Phe, (3Cl)Phe または (2Cl)Phe であり;

$R_6$ はD-Lys, D-Orn または D-Dap であり;

Vは  $(arg-R^1, R^2)_n(X)$  であり、ただしnは1~5であり、 $R^1$ および $R^2$ はH、メチル、エチル、プロピルまたはブチルであり;

$R_7$ はLeu, NML, Nle または Nva であり;

そして

$R_{10}$ はGly-NH<sub>2</sub>, D-Ala-NH<sub>2</sub> または NH-Y であり、ただしYは低級アルキル、シクロアルキル、フルオル低級アルキルまたはNH-CONH-Q (ここでQはHまたは低級アルキルである) である]

で表わされるペプチドまたはその無塩性塩。

(2)  $R_3$ が(6NO<sub>2</sub>)D-Trp であり、 $R_6$ がD-Lys である特許請求の範囲第1項記載のペプチド。

(3)  $R_1$ が $\beta$ -D-2NAL である特許請求の範囲第1項または第2項記載のペプチド。

(4) VがArg<sub>5</sub>(Ac) である特許請求の範囲第1~3項のいずれか1つに記載のペプチド。

(5) XがAc である特許請求の範囲第1~4項のいずれか1つに記載のペプチド。